

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2003-342198
(43)Date of publication of application : 03.12.2003

(51)Int.Cl.

A61K 47/46
A61K 9/14
A61K 9/20
A61P 3/06
A61P 3/10
A61P 9/12
A61P 35/00
A61P 35/02
// A61K 35/78

(21)Application number : 2002-156376

(71)Applicant : GOINO TADASHI

(22)Date of filing : 29.05.2002

(72)Inventor : GOINO TADASHI
KITAMURA TSUZUKI

(54) VEHICLE COMPOSITION

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a functional vehicle composition.

SOLUTION: This vehicle composition comprises one or more ingredients derived from basidiomycetes belonging to Polyporaceae of Basidiomycetes and an ingredient derived from a plant belonging to Araliaceae.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 13.04.2005

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the
examiner's decision of rejection or application
converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of
rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision
of rejection]

[Date of extinction of right]

* NOTICES *

JPO and NCIPI are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
2. *** shows the word which can not be translated.
3. In the drawings, any words are not translated.

CLAIMS

[Claim(s)]

[Claim 1] The constituent containing one sort which is an excipient constituent and belongs to Basidiomycetes Polyporaceae, or two sorts or more of basidiomycete origin components, and the vegetable origin component belonging to Araliaceae.

[Claim 2] Said Basidiomycetes is a constituent according to claim 1 which are a lychee and/or KAWARATAKE.

[Claim 3] The vegetation belonging to said Araliaceae is a constituent according to claim 1 or 2 which is a medicinal ginseng.

[Claim 4] The vegetation belonging to said Araliaceae is a constituent according to claim 1 or 2 which is Panax japonicus.

[Claim 5] It is the constituent said whose excipient it is a constituent for ingestions containing an active principle and an excipient, and is an excipient constituent according to claim 1 to 4.

[Claim 6] A tablet equipped with the shell containing one sort belonging to Basidiomycetes Polyporaceae, or two sorts or more of basidiomycete origin components which are tablets and cover the core containing an active principle, and this core, and the vegetable origin component belonging to Araliaceae.

[Claim 7] The granule containing the particle which has a layer containing one sort belonging to Basidiomycetes Polyporaceae which are a granule and cover the core containing an active principle, and this core, or two sorts or more of basidiomycete origin components, and the vegetable origin component belonging to Araliaceae.

[Claim 8] How to be the manufacture approach of the constituent for ingestions and to have the process which supplies and carries out size enlargement of the excipient constituent according to claim 1 to 4 to an active principle.

[Translation done.]

* NOTICES *

JPO and NCIPI are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
2. **** shows the word which can not be translated.
3. In the drawings, any words are not translated.

DETAILED DESCRIPTION

[Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Field of the Invention] This invention relates to various kinds of constituents for ingestions, such as a tablet using this excipient constituent, further about the excipient constituent used for drugs, food, etc.

[0002]

[Description of the Prior Art] The volume of drugs etc. is adjusted conventionally or, generally the lactose etc. is used as an excipient for giving a predetermined gestalt. Moreover, also in confectionery, health food, etc., the lactose etc. is used as an excipient. Generally as opposed to an active principle besides miscibility with an active principle, or safety, it is required for such an excipient that there is no inhibition factor in pharmaceutical-preparation-izing etc. On the other hand, the active principle of drugs may have secondary operations other than the operation originally expected, even if slight. In such a case, generally taking in drugs and food of the others which can mitigate a side effect is performed.

[0003]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] However, if there is an ingredient in which increase the function by the original active principle to coincidence, and a side effect etc. is made to mitigate, or QOL is raised, and it deals while having the conditions as an allocated type agent, more excellent drugs for a therapy, food, etc. can be offered. So, in this invention, it sets it as the purpose to offer a functional Chinese poem type agent constituent.

[0004]

[Means for Solving the Problem] When this invention persons examined the above-mentioned technical problem, they completed a header and this invention for the above-mentioned technical problem being solvable by using the constituent which has a specific presentation. That is, according to this invention, the following means are offered.

(1) The constituent containing one sort which is an excipient constituent and belongs to Basidiomycetes Polyporaceae, or two sorts or more of basidiomycete origin components, and the vegetable origin component belonging to Araliaceae.

(2) Said Basidiomycetes is a constituent according to claim 1 which are a lychee and/or KAWARATAKE.

(3) The vegetation belonging to said Araliaceae is a constituent according to claim 1 or 2 which is a medicinal ginseng.

(4) The vegetation belonging to said Araliaceae is a constituent according to claim 1 or 2 which is Panax japonicus.

(5) It is the constituent said whose excipient it is a constituent for ingestions containing an active principle and an excipient, and is an excipient constituent according to claim 1 to 4.

(6) The tablet containing the excipient constituent which is a tablet and contains an active principle, and one sort belonging to Basidiomycetes Polyporaceae, or two sorts or more of basidiomycete origin components and the vegetable origin component belonging to Araliaceae.

(7) How to be the manufacture approach of the constituent for ingestions and to have the process which supplies and carries out size enlargement of the excipient constituent of a publication to either of (1) – (4) to an active principle.

[0005] While the basidiomycete origin component and Araliaceae vegetable origin component which are contained in this excipient constituent have the size enlargement nature and the safety for which an excipient is asked, they reinforce an operation of the coexisting active principle, control a side effect, and have an operation of improving the stability of an active principle. For this reason, outstanding drugs or food can be offered by making it **** with an active principle by using these components as an excipient constituent, and making it make an active principle and coincidence prescribe a medicine for the patient thru/or take in.

[0006]

[Embodiment of the Invention] Hereafter, the gestalt of operation of this invention is explained to a detail. The excipient constituent (henceforth this constituent) of this invention contains the component of one or more

kinds of basidiomycete origins belonging to Basidiomycetes Polyporaceae, and the component of the vegetable origin belonging to Araliaceae.

[0007] (Basidiomycetes origin component) As a basidiomycete, it is desirable to use MANNENTAKE and KAWARATAKE at least. Only MANNENTAKE and KAWARATAKE are used especially preferably. In addition, in this specification, the identification on the taxonomy of Basidiomycetes used is based on the collaboration "a primary color Japan fungus pictorial book" (Hoikusha Publishing) of Imazeki 6 ** and Tsugio Hongo.

Basidiomycetes may grow wild naturally, may not be based on the thing grown artificially or a cell culture, either, and is not limited especially. Preferably, it is the thing of natural spontaneous generation.

[0008] It does not limit especially as a basidiomycete belonging to MANNENTAKE. Various MANNENTAKE can be used combining one sort or two sorts or more. Reishi Fungus (*Ganoderma Lucidum*) can be illustrated as desirable MANNENTAKE. Although this bacillus is liked on trees by birth and it breeds, the spontaneous generation bacillus is rare. In addition, artificial cultivation is also possible. This bacillus has the glossy wax-like bulk part and shank, and the die length of that shaft reaches about 15cm. The color of a fruit body presents red, blue, yellow, white, purple, and black. This bacillus grows near the base of a stump top and the tree which was sick and weakened, and serves as a white filament. Furthermore, *Ganoderma pheifferi* and *Ganoderma lipsiense* can be used as other desirable MANNENTAKE. Only either or both sides can also be used. It can also use combining a lychee.

[0009] Moreover, it does not limit especially as KAWARATAKE. various KAWARATAKE -- one sort -- or two or more sorts can be used, combining. *Coriolus Versicolor* can be illustrated as desirable KAWARATAKE. This bacillus grows wild in the western part of Japan especially the Shinshu district (especially Nagano Prefecture), the Shikoku district, and the Kyushu district. By birth, this bacillus is ***** and likes especially a broad-leaved tree. *Trametes hirsutus* can be used as other desirable KAWARATAKE.

[0010] The gestalt used in this invention of these funguses or especially its part is not limited. Although a fruit body, a fungus body culture, etc. can be used, it is a fruit body preferably. In addition, if it is in a fruit body, that by which avoided light and the air dried was carried out at the room temperature is desirable. If it is especially in MANNENTAKE, it is desirable to use the black fruit body which matured in spontaneous generation. Moreover, if it is in KAWARATAKE, it is desirable that it is the fruit body of the spontaneous generation extracted in summer, and that by which avoided light and the air dried was carried out at the room temperature is still more desirable. In addition, especially a fruit body can come to hand with the gestalt of a dry matter besides the thing in the condition of not being processed after extraction, alcoholic immersion fluid, etc. As a raw material of this constituent, a dry matter is used preferably.

[0011] In this constituent, it is desirable to use one sort or two sorts or more from each of MANNENTAKE of the above-mentioned specific kind and KAWARATAKE. For example, it is desirable to use *Coriolus Versicolor* as KAWARATAKE, using a lychee as MANNENTAKE.

[0012] (The acquisition approach of a basidiomycete origin component) The basidiomycete origin component in this constituent can be used as the powder obtained from the concentrate (extractives) by the vacuum concentration of the extract by the basidiomycete raw material (preferably fruit body), the powder which grinds the dry matter and is obtained or water, and/or the organic solvent etc., and a dry matter. In addition, although especially particle size is not limited when it is a powder gestalt, considering as 42 or less meshes is desirable. It is because there is an inclination for making tablet nature to fall when it exceeds 42 meshes.

[0013] when acquiring a basidiomycete origin component as desiccation powder of a basidiomycete material raw material (it does not pass through an extract), without it limits especially the desiccation approach and the disintegration approach of a raw material -- various kinds -- a well-known approach is employable. As the desiccation approach, hot air drying etc. is adopted preferably.

[0014] When acquiring a basidiomycete origin component from the extract by the water and/or the organic solvent (an acetone besides alcohol, such as ethanol and a methanol, etc. can be used) of a basidiomycete raw material, it is desirable to grind a basidiomycete raw material and to consider as the shape of powder and a split beforehand. More preferably, it has the shape of debris below about 7mm angle, and has the shape of a split of about 4mm -- about 6mm angle still more preferably. It has the shape of about 5mm split most preferably. The shape of a split of 0.5mm -- 2mm angle may be desirable. When using a hypha-like somatic cell as a raw material, it is desirable to use the dry powdered object.

[0015] A basidiomycete origin component can also acquire the above-mentioned basidiomycete raw material by extracting by water:alcoholic mixture besides water. Although especially the water to be used is not limited when extracting with water, heating in an extract is desirable. It is about 80-100 degrees C, and is about 90-95 degrees C more preferably. Moreover, although especially the amount of the water to extraction feed is not limited, either, it is desirable to set up the amount of water for an extract to the dry raw material 5 [about] -- the about 25 weight section (preferably about 10 -- the about 20 weight section, still more preferably about 12 -- the about 15 weight section), so that the amount of water after an extract may serve as the about 200 to 800 weight section (preferably about 500 to 700 weight section).

[0016] the time of being carried out in the condition that heating extract operation permits loss in quantity by

evaporation of moisture -- loss in quantity of moisture in the meantime -- assuming -- the original extract -- the amount of service water is set up. for example, the last of a request of amount of water -- to amount of water, it increases about 50 to 60%, and extracts. the extract which it is going to obtain on the other hand more finally than the beginning when carried out in the condition that loss in quantity according [heating extract operation] to evaporation of moisture is not permitted -- what is necessary is just to, heat the water of amount of water in addition to a raw material It carries out using a ring current condenser preferably.

[0017] The container of an atmospheric-air open sand mold and a reflux condenser can be used for heating extract operation. In order to maintain the effectiveness of extract inhibition of an active principle, or an extract component especially, it is desirable to use the ingredient into which the metal part besides the product made from glass, the product made from a hoe low, and the ceramics was painted or processed with the corrosion-resistant coat.

[0018] Although extract time amount does not carry out especially limitation, either, it is desirable, and more preferably, it is 1.5 hours or more that it is at least 1 hour, and it is 2.5 hours or more still more preferably. An upper limit is made into 3 – 4 hours.

[0019] The following actuation can be mentioned as an example of a type in the case of extracting a basidiomycete raw material with water. in all [dry / basidiomycete raw material (it is fruit body preferably and is split-like preferably.)] -- about 20g -- receiving -- 800ml – 1000ml of hot water -- in addition -- while maintaining at 90–95 degrees C -- an extract residue -- about 200– it brews so that it may be set to about 700ml. Preferably, heating adjustment which is set to about 200ml – about 700ml in about 1.5 – 3 hours is performed. Or 200ml – about 700ml of **** is added to about 20g, and it is made to boil for about 2 hours using a reflux condenser.

[0020] It is desirable to use ethanol, when alcohol extracts. Although only alcohol may extract when extracting using alcohol, it is desirable to mix with water and to extract by mixture preferably. Alcoholic concentration is under 50 v/v% and may be about 35 v/v% more preferably. Although especially an alcoholic content extract does not limit, heating in an extract is desirable. Preferably, it is 50–80 degrees C, and it is 75 degrees C or less, and is 70 degrees C or less still more preferably. Although extract time amount does not carry out especially limitation, either, it is desirable that it is 10 hours or more, it is 20 hours or more more preferably, and is about 30 hours or more than it most preferably. moreover -- although it is not what also limits especially the amount of extracts to extraction feed -- the raw material about 50 to 250 weight section -- it is desirable more preferably the 100 – 200 weight section and to consider as the extract 1000 weight section finally to the about 120 to 150 weight section still more preferably. As for the container for an extract, it is desirable to use the same thing as the case where it extracts only with water. As for extract operation, it is desirable to carry out using a ring current condenser.

[0021] In addition, when extracting using alcohol, the component which is not extracted only with water is extracted. beta-glucan, such as hetero-beta-glucan, xylo-beta-glucan, and MANNO-beta-glucan, is contained in the ** ethanol extract of Basidiomycetes by triterpenoid, the nucleoside (an adenosine, guanosine), and polysaccharide.

[0022] The following actuation can be mentioned as an example of a type in the case of extracting a basidiomycete raw material by water / alcoholic mixture. A 35 v/v% ethanol solution is added to about 120–200g (it is a fruit body preferably and is a split-like preferably) of basidiomycete raw materials crushed in the shape of a split, and it is referred to as 1000ml, and this liquid is maintained at about 70 degrees C, and is brewed for about 30 hours. After 30-hour progress, hot water (or water) is added so that the whole quantity may be set to 1000ml. In addition, it is desirable that alcoholic concentration finally becomes less than [abbreviation 20 v/v%].

[0023] As for the obtained various extracts, filtration etc. is carried out if needed. Furthermore, it considers as a concentrate (extractives) with vacuum concentration etc., and after that, it dries if needed and considers as powder further. It is desirable to adopt a spray dry method from a viewpoint dried in large quantities as the desiccation approach. Moreover, since the rise of the temperature of goods is avoidable, in the point maintained without decomposing an active principle, it is desirable to adopt a freeze-drying method. Although it can be used as a basidiomycete origin component in this constituent, about an extract and a concentrate, it becomes easy to use each of extracts, concentrates, and dry matters by mixing with an extract dry matter or grinding powder as stated above as an excipient constituent component.

[0024] (Active principle of the root origin of the Araliaceae vegetation) The component extracted from the Araliaceae vegetation can be contained in the constituent of this invention. Especially the Araliaceae vegetation is not limited. The various Araliaceae vegetation can be used combining one sort or two sorts or more. The desirable Araliaceae vegetation is panacis japonici rhizoma (Panax japonicus) (Tamako 3, P.japonicus C.A.Meyer, or JapanesePanax ginseng). Moreover, as Araliaceae vegetation, a U.S. ginseng radix (P.quinquefolium L.) besides an OTANE ginseng radix (Panaxginseng C.A.Meyer) and no less than 37 ginseng radices (the Panax Notoginseng ginseng radix, P.notogingseng) can be used. In order to obtain the component of the constituent of this invention, it is desirable to use the vegetation (henceforth Panax schinseng etc.) chosen from Panax schinseng and its

close species and the vegetation (henceforth *Panax japonicus* etc.) chosen from *Panax japonicus* and its close species. In this constituent, the root of these vegetation is used preferably. The root of these ginsengs including the root of *Panax schinseng*, *Panax japonicus*, and these close-species vegetation can usually come to hand in the condition of having dried. Or it can obtain also as alcoholic immersion fluid etc. As a raw material of this constituent, a dry matter is used preferably.

[0025] Although the root of the Araliaceae vegetation may be the so-called root of a plant body, it may be a cultured cell. It is the cultured cell of the root origin preferably [in the case of a cultured cell]. In addition, if the root origin raw material of a plant body is included, a raw material including other parts other than the root of a plant body can also be used.

[0026] (The acquisition approach of an Araliaceae vegetable origin component) The active principle in this constituent can be dried if needed, and can use an Araliaceae vegetable raw material as the powder obtained from the concentrate (extractives) obtained by the vacuum concentration of the extract of the powder obtained by carrying out grinding etc., or the raw material concerned etc., or a dry matter again. In the case of a powder gestalt, especially particle size is not limited, but considering as 42 or less meshes is desirable. It is because the making tablet engine performance will be affected if it exceeds 42 meshes.

[0027] when acquiring an Araliaceae vegetable origin component as grinding (it dries preferably) powder of an Araliaceae vegetable raw material, without it limits especially the desiccation approach and the disintegration approach of a raw material -- various kinds -- a well-known approach is employable. As the desiccation approach, hot air drying etc. is preferably employable.

[0028] When using an Araliaceae vegetable origin component as the extractives powder obtained from the extract by the water and/or the organic solvent (an acetone besides alcohol, such as ethanol and a methanol, etc. can be used) of a raw material, what the raw material is beforehand made into the shape of powder and a split for in the extract is desirable. It has the shape of debris below about 7mm angle, and still more preferably, it is about 4mm - about 6mm, and has the shape of about 5mm split most preferably. The shape of a split of 0.5mm - 2mm angle may be desirable. When using a cultured cell as a raw material, it is desirable to use the dry powdered object.

[0029] Although especially the water to be used is not limited when extracting with water, heating in an extract is desirable. It is about 80 - 100 degrees C of abbreviation, and they are about 90 - 95 degrees C of abbreviation more preferably. moreover -- although it is not what also limits especially the amount of the water to extraction feed -- a raw material 3 [about] - the about 25 weight section -- it is desirable preferably about 5 - the about 20 weight section, and to set up the amount of water for an extract to the about 20 weight section, more preferably, so that the amount of water after an extract may become about 200 - the about 800 weight section (preferably about 500 to 700 weight section). When the last extract is prepared by this density range, while remaining as it is and being concentration desirable to internal use, it is because an effective extract is performed.

[0030] the time of being carried out in the condition that heating extract operation permits loss in quantity by evaporation of moisture -- loss in quantity of moisture in the meantime -- assuming -- the original extract -- the amount of service water is set up. for example, the last of a request of amount of water -- to amount of water, it increases about 50 to 60%, and extracts. the extract which it is going to obtain on the other hand more finally than the beginning when carried out in the condition that loss in quantity according [heating extract operation] to evaporation of moisture is not permitted -- what is necessary is just to, heat the water of amount of water in addition to a raw material It carries out using a ring current condenser preferably.

[0031] The container of an atmospheric-air open sand mold and a reflux condenser can be used for heating extract operation. In order to maintain the effectiveness of extract inhibition of an active principle, or an extract component especially, it is desirable to use the ingredient into which the metal part besides the product made from glass, the product made from a hoe low, and the ceramics was painted or processed with the corrosion-resistant coat. Although extract time amount does not carry out especially limitation, either, it is desirable, and more preferably, it is 1.5 hours or more that it is at least 1 hour, and it is 2.5 hours or more still more preferably. An upper limit is made into 3 - 4 hours.

[0032] The following actuation can be mentioned as an example of a type in the case of extracting with water the root of the Araliaceae vegetation which is a plant body. It brews so that an extract residue may be set to about 200ml - about 700ml to desiccation **** 3-20g of the ginseng crushed in the shape of a split in the heating range which added and described above 800ml - 1000ml of hot water. Preferably, heating adjustment which is set to about 200ml - about 700ml in about 1.5 - 3 hours is performed, maintaining extract temperature at 90-95 degrees C. It is good to carry out a boiling extract especially for about 2 hours using a ring current condenser to the ginseng raw material of tales doses by 200ml - about 700ml of ****. The extract obtained by such actuation serves as a liquid of concentration which fitted internal use as it is.

[0033] It is desirable to use ethanol, when alcohol extracts. Although only alcohol may extract when extracting using alcohol, it is desirable to mix with water and to extract by mixture preferably. Alcoholic concentration is under 50 v/v% and may be about 35 v/v% more preferably. Although especially an alcoholic content extract does

not limit, heating in an extract is desirable. Preferably, it is 50-80 degrees C, and it is 75 degrees C or less, and is 70 degrees C or less still more preferably. Although extract time amount does not carry out especially limitation, either, it is desirable that it is 10 hours or more, it is 20 hours or more more preferably, and is about 30 hours or more than it most preferably. In addition, at the time of final internal use, it is desirable that alcoholic concentration is about 20 v/v%. For example, when the alcoholic solution of the concentration exceeding 20 v/v% extracts, it is desirable to dilute with water and to make it become less than [20 v/v%] after an extract. It is less than [10 v/v%] and is less than [5 v/v%] more preferably. Moreover, although especially the amount of extracts to extraction feed (root of a ginseng) is not limited, either, it is desirable to consider as 1000ml of extracts to about 30-200g of raw materials. As for the container for an extract, it is desirable to use the same thing as the case where it extracts only with water. As for extract operation, it is desirable to carry out using a ring current condenser.

[0034] The following actuation can be mentioned as an example of a type in the case of extracting the root of the Araliaceae vegetation by water / alcoholic mixture. A 35 v/v% ethanol solution is added to 200g of desiccation **** of the Araliaceae vegetation crushed in the shape of a split, and it is referred to as 1000ml, and this liquid is maintained at about 70 degrees C, and is brewed for about 30 hours. After 30-hour progress, hot water (or water) is added so that the whole quantity may be set to 1000ml. In addition, it is desirable that alcoholic concentration finally serves as abbreviation 20 v/v%.

[0035] As for the obtained extract, filtration etc. is carried out if needed. Furthermore, it considers as a concentrate (extractives) with vacuum concentration etc., and after that, it can dry if needed and can consider as powder further. It is desirable to adopt a spray dry method from a viewpoint dried in large quantities as the desiccation approach. Moreover, since the rise of the temperature of goods is avoidable, in the point maintained without decomposing an active principle, it is desirable to adopt a freeze-drying method. Although it can be used as an Araliaceae vegetable origin component in this constituent, about an extract and a concentrate, it becomes easy to use each of extracts, concentrates, and dry matters by mixing with an extract dry matter or grinding powder as stated above as an excipient constituent component.

[0036] In addition, although an extract can also be separately prepared about each class when using two or more kinds of basidiomycetes as a basidiomycete raw material, it can also extract collectively to coincidence. The same is said of the Araliaceae vegetation. Furthermore, although a basidiomycete raw material and the root raw material of the Araliaceae vegetation can also be extracted independently, respectively, they can extract a raw material constituent including both sides by the same extract medium, and can also extract it to coincidence. Preferably, a coincidence extract is carried out. When carrying out a coincidence extract, one in the above-mentioned basidiomycete raw material or the root raw material of the Araliaceae vegetation of extraction conditions can be adopted.

[0037] Moreover, each various modes described above as the basidiomycete origin component and Araliaceae vegetable origin component in this constituent are combinable suitably. That is, a basidiomycete origin component and an Araliaceae vegetable origin component have grinding powder and the various gestalten via an extract (an extract, extractives, desiccation powder), can choose one sort from a component gestalt, or two sorts or more, respectively, and can constitute this constituent. Preferably, it is desirable as an Araliaceae vegetable origin component of a basidiomycete origin component to use crushing powder, respectively. Moreover, each [these] crushing powder is made into a subject, and it is also a desirable mode suitably to mix one sort of the various gestalten via an extract of each component or two sorts or more. According to such a mode, the concentration of each component in an excipient constituent can be raised.

[0038] moreover — as the weight ratio at the time of converting into the dry weight of each raw material, although the ratio of the basidiomycete raw material in this constituent and the raw material of the Araliaceae vegetation could be set up suitably — about 13.5 — about 16.5(preferably about 15): — about 2.7- it can be referred to as about 3.3 (preferably about 3). the case where a basidiomycete raw material is especially made into MANNENTAKE and KAWARATAKE — the ratio of MANNENTAKE:KAWARATAKE:Araliaceae vegetation — about 9- about 11 (preferably about 10), about 4.5 — about 5.5(preferably about 5): — about 2.7- it can be referred to as about 3.3 (preferably about 3). furthermore, the ratio of a basidiomycete raw material and an Araliaceae vegetable raw material — about 18 — about 22(preferably about 20): — about 9- it can be referred to as about 11 (preferably about 10). moreover, the ratio of MANNENTAKE:KAWARATAKE:Araliaceae vegetation — about 4.5- about 5.5 (preferably about 5), about 9 — about 11(preferably about 10): — about 2.7- it can be referred to as about 3.3 (preferably about 3). the ratio of a basidiomycete raw material and an Araliaceae vegetable raw material — about 18 — about 22(preferably about 20): — about 9- it can be referred to as about 11 (preferably about 10). the case where a basidiomycete raw material is especially made into MANNENTAKE and KAWARATAKE — the ratio of MANNENTAKE:KAWARATAKE:Araliaceae vegetation — about 9- about 11 (preferably about 10), and about 9 — about 11(preferably about 10): — about 9- it can be referred to as about 11 (preferably about 10).

[0039] Thus, each of basidiomycete origin components obtained and Araliaceae vegetable origin components is using polysaccharide as the principal component. Moreover, it has moderate compressibility, the collapsibility at

the time of water immersion, or elution nature. Therefore, the constituent for ingestions can be easily offered by supplying and carrying out size enlargement of this constituent to the powder of the active principle of arbitration, a concentrate (extractives), etc. For this reason, this constituent can be preferably used as an excipient of constituents for ingestions, such as an eating-and-drinking article containing a supplement besides various pharmaceutical preparation for ingestions, such as a tablet, a granule, powder, and a coated tablet agent. [0040] For example, when applying to a tablet or a granule, it can constitute so that the excipient constituent containing an active principle, and one sort belonging to Basidiomycetes Polyporaceae or two sorts or more of basidiomycete origin components and the vegetable origin component belonging to Araliaceae may be contained. Moreover, it can also consider as a tablet equipped with the shell containing one sort belonging to Basidiomycetes Polyporaceae, or two sorts or more of basidiomycete origin components which cover the core containing an active principle, and this core, and the vegetable origin component belonging to Araliaceae. In this case, shell can constitute a coating layer or a glycocalyx layer. Moreover, when considering as a granule, it can constitute so that the particle which has a layer containing one sort belonging to Basidiomycetes Polyporaceae which cover the core containing an active principle and this core, or two sorts or more of basidiomycete origin components, and the vegetable origin component belonging to Araliaceae may be contained.

[0041] In addition, the mode of the constituent for ingestions using this constituent can be used as the food containing luxury goods, such as drinks, such as confectionary, such as pharmaceutical preparation (the pharmaceutical preparation as other health food of drugs is included), such as a capsule besides the above, and a chewable agent, a chewing gum, ice cream, a candy, Cookie, a biscuit, and snack confectionery, and tea, or powder for drink preparation, etc. moreover, the business which adds moisture and can recover a liquefied object at the time of use -- it is also desirable to consider as the solid-state (powder or Plastic solid) of the time solubility. Commercial production of a selection, pharmaceutical-preparation-izing, an eating-and-drinking article according to the selection, etc. of this gestalt is a well-known matter in this contractor. Furthermore, it can be used also as a fermentation promotion additive and the fermented food which contains this constituent as the additive concerned can also be offered.

[0042] Moreover, the basidiomycete origin component and Araliaceae vegetable origin component which this constituent contains have the both sides of the active principle of the basidiomycete origin, and an Araliaceae vegetable origin component essentially, respectively. Therefore, the various bioactive operations which these active principles have can be given to a product by using this constituent as an excipient. According to this invention persons, it turns out that such bioactive is antitumor activity, antihyperlipidemic activity, blood-pressure descent activity, blood sugar level descent activity, etc.

[0043] Especially the antitumor activity that this constituent discovers has the activity over leukemia, a lymphoma, cervical cancer, lung cancer, an ovarian cancer, a mammary gland gun (transition), skin cancer (transition), a mammary gland gun, and skin cancer. Erythroblast leukemia can be illustrated as leukemia.

[0044] The antihyperlipidemic activity which the constituent of this invention discovers has the total cholesterol fall operation in the blood of the mammals including Homo sapiens. Moreover, in Homo sapiens, it has the operation which reduces much LDL cholesterol relatively to HDL cholesterol especially. Moreover, it has the operation which makes HDL cholesterol increase. In addition, in Homo sapiens, it has the fall operation of the neutral fat represented with the triglyceride concentration in blood.

[0045] The blood sugar levels are normal (typically, fasting blood sugar is 120 or less mg/dl) – a border area (for example, fasting blood sugar exceeding 120 mg/dl less than 140 mg/dl), and, especially as for the total cholesterol fall operation in Homo sapiens, an LDL cholesterol fall operation, the increment operation in HDL cholesterol, etc., total cholesterol is effectively demonstrated in the patient of normal – hyperlipidemia. To these patients, a fall operation of the amount of triglyceride in blood is also demonstrated. That is, this constituent can act effective in diabetes mellitus and the hyperlipidemia as complication especially in an insulin non-dependency diabetic, and can reduce total cholesterol and/or LDL cholesterol. In addition, the constituent of this invention also combines and has the insulin Mr. operation. That is, when a diabetic is medicated, the fall of the blood drug concentration of the blood sugar level and C-peptide is observed. Therefore, this constituent can be used also as the object for diabetic prevention, or a constituent for a therapy.

[0046] The constituent of this invention can be used together to administration of other drugs for a diabetes-mellitus therapy to an insulin non-dependency diabetic. That is, this constituent does so a total cholesterol fall operation and an LDL cholesterol fall operation, when it uses together with other agents for a diabetes-mellitus therapy. This constituent can hardly discover the side effect by administration of the constituent itself, and can reduce the side effect by other diabetes-mellitus therapy agents according to an immunity activation operation etc.

[0047] The health promotion phenomenon of better appetite as which the constituent of this invention senses the force in the dissolution of the numbness of hand and foot and the body after administration thru/or eating-and-drinking initiation and to which a pile and a complexion become good at relaxation of the pain of the body and the fatigue is observed.

[0048] While the constituent of this invention has a fall operation of a fall operation of the above-mentioned

cholesterol etc., the blood sugar level, etc., it also combines and has the above-mentioned health promotion operation in coincidence at coincidence. From this, by using it with the end of active principle Hara for [various] a disease therapy etc., this constituent can mitigate these side effects of this constituent to coincidence, and can plan health promotion. That is, the constituent for ingestions which used this constituent is the constituent which can improve QOL and can improve with the therapy thru/or preventive effect by the active principle. [0049] In addition, higher bioactive can be discovered according to the synergistic effect of the active principle and this constituent concerned by using this constituent as an excipient to the active principle which has bioactive similar to the bioactive or this which this above-mentioned constituent has. Moreover, coincidence can be provided with the constituent for ingestions which can discover mitigation of the side effect by the active principle concerned, and a health promotion operation. Moreover, as an excipient to the active principle of the basidiomycete origin by this constituent, and/or the active principle of the Araliaceae vegetable origin, by applying this constituent, the amount of active principles per product can be increased, and, thereby, the manifestation of the high efficacy effectiveness is attained.

[0050] Moreover, the basidiomycete origin component in this constituent and the Araliaceae vegetable origin component have the antioxidation operation, although a reason is not clear. If the solution or suspension of these origin components is left in air, the potential of this is clear from falling gradually. Therefore, the oxidative degradation of the active principle in the constituent for ingestions can be prevented, and the stability of an active principle can be raised. Therefore, while this constituent is an excipient, it can function also as the anti-oxidant or stabilizing agent of an active principle, and the constituent for ingestions which holds the outstanding active principle stability can be offered by using this constituent.

[0051] In addition, ingredients, such as a lactose used as an excipient conventionally used as an excipient conventionally besides the Basidiomycetes origin component and an Araliaceae vegetable origin component, and starch, hydroxypropylcellulose, can also be included in this constituent. Moreover, the grinding powder of other raw materials, an extract and extract extractives, and extract extractives desiccation powder can also be included. For example, shiitake mushroom, a Jew's-ear, etc. can be used.

[0052]

[Example] Hereafter, although an example is given and explained about this invention, this invention is not restrictively interpreted at all according to these examples.

(Example 1) The production process of the extract extractives powder which constitutes an active principle in drawing 1 is shown. water after grinding lychee (dry matter) 500g, KAWARATAKE(dry matter) 500g, Panax japonicus (dry matter) 500g, 150g [of shiitake mushroom] (dry matter), 150g [of Jew's-ears] (dry matter), 20g [of soybeans] (dry matter), and 20g (dry matter) of fall student clothes, respectively and using them as split 40L -- in addition, it extracted, flowing back at 100 degrees C for 1 hour. This extract was filtered by 200 meshes and vacuum concentration was carried out by 650mmHg at 65 degrees C after that.

[0053] The conditions dried by the spray-drying method after heating the obtained concentrate for 30 minutes and sterilizing it at 95 degrees C were made into the inlet temperature of 200 degrees C, and the outlet temperature of 100 degrees C. Moreover, the solid content concentration of the concentrate before desiccation was about 20%.

[0054] Screening of the obtained desiccation powder was carried out by 42 meshes, and it considered as extract extractives powder. In addition, recovery was about 20% of raw material weight. In addition, this extract extractives powder is also the excipient constituent (extract course) of this invention at coincidence.

[0055] (Example 2) After grinding lychee (dry matter) 500g, KAWARATAKE(dry matter) 250g, and Panax japonicus (dry matter) 150g, respectively and using it as a split, further, it impalpable-powder-ized, screening was carried out by 42 meshes, and it considered as the excipient constituent (impalpable powder).

[0056] (Example 3)

(Making tablet trial 1) The process of the making tablet trials 1 and 2, a presentation, and a making tablet result are shown in drawing 2 . The exam considered as the blend for making tablets only using the extract extractives powder of an example 1, and performed the making tablet. On the occasion of the making tablet, the blend for making tablets was introduced into the tableting machine of predetermined size so that it might be set to 75mg per one lock, and the tablet with a thickness [of 3.2mm] and a particle size of 6.5mm was obtained.

[0057] (Making tablet trial 2) The exam considered as the blend for making tablets only using the excipient constituent (impalpable powder) of an example 2, and performed the making tablet. On the occasion of the making tablet, the blend for making tablets was introduced into the tableting machine of predetermined size so that it might be set to 74mg per one lock, and the tablet with a thickness [of 3.3mm] and a particle size of 6.5mm was obtained.

[0058] The tablets obtained by the making tablet trial 1 were a degree of hardness 1.9 and 5.40% (Karl Fischer technique) of moisture. Moreover, the tablets obtained by the making tablet trial 2 were a degree of hardness 1.5 and 4.60% (Karl Fischer technique) of moisture. Moreover, also in which making tablet activity, it applied, and there was almost no ***** etc., and the underwater collapsibility of a tablet was also good.

[0059] According to the making tablet trial, it turned out that each excipient constituent has the good making

tablet engine performance. Moreover, when miscibility with a lactose was checked, the ***** concerned was also good and it also turned out that an excipient constituent can be constituted with a lactose.

[Translation done.]

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2003-342198

(P2003-342198A)

(43)公開日 平成15年12月3日 (2003.12.3)

(51)Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	マークコード(参考)
A 6 1 K	47/46	A 6 1 K	47/46
	9/14		9/14
	9/20		9/20
A 6 1 P	3/06	A 6 1 P	3/06
	3/10		3/10

審査請求 未請求 請求項の数 8 O L (全 9 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2002-156376(P2002-156376)

(22)出願日 平成14年5月29日 (2002.5.29)

(71)出願人 500046564
五井野 正
長野県南安曇郡穂高町有明7362-1

(72)発明者 五井野 正
長野県南安曇郡穂高町有明7362-1

(72)発明者 北村 都築
愛知県名古屋市中区千代田1-10-4
光ハイツ 矢場町502

(74)代理人 100064344
弁理士 岡田 英彦 (外3名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 賦形剤組成物

(57)【要約】

【課題】機能性賦形剤組成物を提供する。

【解決手段】担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する、賦形剤組成物を提供する。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 賦形剤組成物であって、

担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する、組成物。

【請求項2】 前記担子菌類は、レイシおよび／またはカワラタケである、請求項1記載の組成物。

【請求項3】 前記ウコギ科に属する植物は、薬用ニンジンである、請求項1又は2に記載の組成物。

【請求項4】 前記ウコギ科に属する植物は、チクセツニンジンである、請求項1又は2に記載の組成物。

【請求項5】 有効成分と賦形剤とを含有する経口摂取用組成物であって、前記賦形剤は請求項1～4のいずれかに記載の賦形剤組成物である、組成物。

【請求項6】 錠剤であって、

有効成分を含むコアと、

このコアを被覆する、担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有するシェル、とを備える、錠剤。

【請求項7】 粒剤であって、

有効成分を含むコアとこのコアを被覆する担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する層とを有する粒子を含有する、粒剤。

【請求項8】 経口摂取用組成物の製造方法であって、有効成分に対して、請求項1～4のいずれかに記載の賦形剤組成物を供給して賦形する工程を有する、方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 この発明は、医薬品や食品などに使用する賦形剤組成物に関し、さらに、この賦形剤組成物を用いた錠剤などの各種の経口摂取用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】 従来、薬剤の体積などを調整したり、所定の形態を付与するための賦形剤としては、乳糖などが一般的に用いられている。また、菓子や健康食品などにおいても、賦形剤として、乳糖などが用いられている。このような賦形剤には、一般的には、有効成分との混合性や安全性の他、有効成分に対し、あるいは製剤化などにおける阻害要因がないことが要求される。一方、薬剤の有効成分には、軽微であっても本来期待される作用以外の副次的作用がある場合もある。このような場合、副作用を軽減できる他の薬剤や食品を摂取することが一般的に行われている。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】 しかしながら、賦形剤としての条件を備えるとともに、同時に本来の有効成分による機能を増大させ、副作用などを軽減させ、あるいは

はQOLを向上させうる材料があれば、より優れた治療用薬剤や食品などを提供することができる。そこで、本発明では、機能性賦形剤組成物を提供することを、その目的とする。

【0004】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、上記した課題について検討したところ、特定の組成を有する組成物を用いることにより、上記した課題を解決できることを見出し、本発明を完成した。すなわち、本発明によれば、以下の手段が提供される。

(1) 賦形剤組成物であって、担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する、組成物。

(2) 前記担子菌類は、レイシおよび／またはカワラタケである、請求項1記載の組成物。

(3) 前記ウコギ科に属する植物は、薬用ニンジンである、請求項1又は2に記載の組成物。

(4) 前記ウコギ科に属する植物は、チクセツニンジンである、請求項1又は2に記載の組成物。

(5) 有効成分と賦形剤とを含有する経口摂取用組成物であって、前記賦形剤は請求項1～4のいずれかに記載の賦形剤組成物である、組成物。

(6) 錠剤であって、有効成分と、担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する賦形剤組成物とを含有する、錠剤。

(7) 経口摂取用組成物の製造方法であって、有効成分に対して、(1)～(4)のいずれかに記載の賦形剤組成物を供給して賦形する工程を有する、方法。

【0005】 本賦形剤組成物に含まれる担子菌由来成分とウコギ科植物由来成分は、賦形剤に求められる賦形性と安全性を有すると同時に、併存する有効成分の作用を増強し、副作用を抑制し、有効成分の安定性を向上するなどの作用を有する。このため、これらの成分を賦形剤組成物として、有効成分と併存させ、有効成分と同時に投与ないし摂取させることにより、優れた薬剤あるいは食品を提供することができる。

【0006】

【発明の実施の形態】 以下、本発明の実施の形態について詳細に説明する。本発明の賦形剤組成物（以下、本組成物ともいう。）は、担子菌類サルノコシカケ科に属する1種類以上の担子菌由来の成分とウコギ科に属する植物由来の成分とを含有している。

【0007】 (担子菌類由来成分) 担子菌としては、少なくともマンネンタケおよびカワラタケとを用いることが好ましい。特に好ましくは、マンネンタケとカワラタケとのみを用いる。なお、本明細書において、用いられる担子菌類の分類学上の同定は、今閏六也、本郷次雄の共著「原色日本菌類図鑑」（保育社）に準拠している。

50 担子菌類は、天然に自生するものでもよく、また、人工

的に栽培したもの、あるいは細胞培養によるものでもあってもよく、特に限定しない。好ましくは、天然自生のものである。

【0008】マンネンタケに属する担子菌としては、特に限定しない。各種マンネンタケは1種あるいは2種以上を組み合わせて使用することができる。好ましいマンネンタケとして、*Reishi Fungus (Ganoderma Lucidum)*を例示することができる。この菌は、生来、樹木に好んで繁殖するものの、自生菌は稀少である。なお、人工栽培も可能である。この菌は、つやのある、ワックス状のかさ部分と軸部とを有しており、その軸の長さは、15cm程度にも到達される。子実体の色は、赤色、青色、黄色、白色、紫色、黒色を呈する。この菌は、切り株や、病気で弱った木の基部付近で生長し、白い糸状体となる。さらに、他の好ましいマンネンタケとしては、*Ganoderma pheifferi*および*Ganoderma lipsiense*を使用することができる。いずれか一方あるいは双方のみを使用することもできる。レイシと組み合わせて用いることができる。

【0009】また、カワラタケとしては、特に限定しない。各種カワラタケを1種あるいは2種以上組み合わせて使用することができる。好ましいカワラタケとしては、*Coriolus Versicolor*を例示することができる。この菌は、日本の西部、特に、信州地方（特に、長野県）、四国地方、九州地方に自生している。この菌は、生来、好材菌であり、特に広葉樹を好む。他の好ましいカワラタケとしては、*Trametes hirsutus*を使用することができる。

【0010】これらの菌類の、本発明において使用する形態、あるいはその部位は、特に限定しない。子実体及び／又は菌体培養物などを使用することができるが、好ましくは子実体である。なお、子実体にあっては、室温で光を避けて風乾されたものが好ましい。特にマンネンタケにあっては、自生で成熟した黒色の子実体を用いるのが好ましい。また、カワラタケにあっては、夏に採取された自生の子実体であることが好ましく、室温で光を避けて風乾されたものがさらに好ましい。なお、子実体は、採取後特に加工されていない状態のものその他、乾燥物、アルコール浸漬液などの形態で入手することができる。本組成物の原料としては、好ましくは乾燥物を用いる。

【0011】本組成物においては、上記特定種のマンネンタケとカワラタケとのそれぞれから1種あるいは2種以上を用いることが好ましい。例えば、マンネンタケとしてレイシを用い、カワラタケとして、*Coriolus Versicolor*を用いることが好ましい。

【0012】（担子菌由来成分の取得方法）本組成物における担子菌由来成分は、担子菌原料（好ましくは子実体）あるいは、その乾燥物を粉碎して得られる粉末、あるいは、水および／または有機溶媒による抽出液の減圧

濃縮などによる濃縮物（エキス）、乾燥物から得られる粉末とすることができます。なお、粉末形態である場合、粒径は特に限定しないが、42メッシュ以下とすることが好ましい。42メッシュを超えると打錠性が低下する傾向があるからである。

【0013】担子菌由来成分を、担子菌材原料（抽出を経ない）の乾燥粉末として取得する場合、原料の乾燥方法や粉末化方法は特に限定しないで、各種公知の方法を採用することができる。乾燥方法としては、熱風乾燥などが好ましく採用される。

【0014】担子菌由来成分を、担子菌原料の水および／または有機溶媒（エタノール、メタノールなどのアルコールの他、アセトンなどを用いることができる）による抽出液から取得する場合、予め、担子菌原料を粉碎し、粉状、細片状とすることが好ましい。より好ましくは、約7mm角以下の碎片状であり、さらに好ましくは、約4mm～約6mm角の細片状である。最も好ましくは約5mmの細片状である。0.5mm～2mm角の細片状が好ましい場合もある。菌糸状体細胞を原料とする場合には、乾燥した粉末状体を用いることが好ましい。

【0015】担子菌由来成分は、上記した担子菌原料を、水の他、水：アルコール混液により抽出することにより取得することもできる。水で抽出する場合、使用する水は特に限定しないが、抽出にあたって加熱することが好ましい。好ましくは、約80～100℃であり、より好ましくは、約90～95℃である。また、抽出原料に対する水の量も特に限定するものではないが、乾燥した原料約5～約25重量部（より好ましくは、約10～約20重量部、さらに好ましくは、約12～約15重量部）に対して、抽出後の水量が約200～800重量部（好ましくは、約500～700重量部）となるように抽出用の水量を設定することが好ましい。

【0016】加熱抽出操作が、水分の蒸発による減量を許容する状態で行われるときは、その間の水分の減量を想定して、当初の抽出用水の量を設定する。例えば、水量を所望の最終水量に対して50～60%程度增量して抽出する。一方、加熱抽出操作が、水分の蒸発による減量が許容されない状態で行われるときには、当初より、最終的に得ようとする抽出水量の水を原料に対して加えて加熱を行えばよい。好ましくは環流凝縮器を用いて行う。

【0017】加熱抽出操作は、大気開放型の容器や、還流凝縮器を用いることができる。特に、有効成分の抽出阻害や抽出成分の有効性を維持するために、ガラス製、ホーロー製、セラミックス製の他、金属部分を耐食性被膜で塗装あるいは加工した材料等を使用することが好ましい。

【0018】抽出時間も特に限定はしないものの、少なくとも1時間であることが好ましく、より好ましくは、

1. 5時間以上であり、さらに好ましくは2. 5時間以上である。上限は3~4時間とする。

【0019】担子菌原料を水で抽出する場合の典型例として以下の操作を挙げることができる。乾燥した担子菌原料（好ましくは子実体であり、好ましくは細片状である。）合わせて約20gに対して、熱水800ml~1000mlを加えて、90~95℃に維持しながら抽出液残量が約200~約700mlになるように煎じる。好ましくは、1. 5~3時間程度で約200ml~約700mlとなるような加熱調整を行う。あるいは、約20gに対して水約200ml~約700mlを加えて還流凝縮器を用いて約2時間煮沸させる。

【0020】アルコールで抽出する場合、エタノールを使用することが好ましい。アルコールを用いて抽出する場合、アルコールのみで抽出してもよいが、好ましくは、水と混合して混液で抽出することが好ましい。好ましくは、アルコール濃度が50v/v%下であり、より好ましくは35v/v%程度とする。アルコール含有抽出液は、特に限定しないが、抽出にあたって加熱することが好ましい。好ましくは、50~80℃であり、より好ましくは、75℃以下であり、さらに好ましくは70℃以下である。抽出時間も特に限定はしないものの、10時間以上あることが好ましく、より好ましくは20時間以上であり、最も好ましくは30時間程度あるいはそれ以上である。また、抽出原料に対する抽出液量も特に限定するものではないが、原料約50~250重量部、より好ましくは、100~200重量部、さらに好ましくは約120~150重量部に対して最終的に抽出液100重量部とすることが好ましい。抽出のための容器は、水のみで抽出する場合と同様のものを使用することが好ましい。抽出操作は、環流凝縮器を用いて行うのが好ましい。

【0021】なお、アルコールを用いて抽出する場合には、水のみでは抽出されない成分が抽出されてくる。担子菌類の含エタノール抽出液には、トリテルペノイド、ヌクレオシド（アデノシン、グアノシン）、多糖体では、ヘテロ-β-グルカン、キシロ-β-グルカン、マノ-β-グルカンなどのβ-グルカンが含まれる。

【0022】担子菌原料を水/アルコール混液で抽出する場合の典型例として以下の操作を挙げることができる。細片状に破碎した担子菌原料（好ましくは子実体であり、好ましくは細片状である）約120~200gに、35v/v%エタノール溶液を加えて1000mlとし、この液を約70℃に維持して約30時間煎じる。30時間経過後、全量が1000mlとなるように熱水（あるいは水）を加える。なお、最終的にアルコール濃度が約20v/v%以下となることが好ましい。

【0023】得られた各種抽出液は、必要に応じてろ過等される。さらに、減圧濃縮などにより濃縮物（エキス）とし、その後、必要に応じて乾燥し、さらに粉末と

する。乾燥方法としては、大量に乾燥する観点からはスプレードライ方式を採用することが好ましい。また、品温の上昇が回避できるため、有効成分が分解されずに維持される点においては、凍結乾燥方式を採用することが好ましい。抽出液、濃縮物、乾燥物は、いずれも、本組成物における担子菌由来成分として使用することができるが、抽出液及び濃縮物については、抽出液乾燥物あるいは既述の粉碎粉末と混合することにより、賦形剤組成物成分として使用しやすくなる。

【0024】（ウコギ科植物の根由来の有効成分）本発明の組成物には、ウコギ科植物から抽出される成分を含有することができる。ウコギ科植物は、特に限定しない。各種ウコギ科植物を1種あるいは2種以上を組み合わせて使用することができる。好ましいウコギ科植物は、竹節人参（チクセツニンジン）（珠子参、*P. japonicus* C. A. MeyerあるいはJapanesePanax ginseng）である。また、ウコギ科植物としては、オタネ人参（*Panax ginseng* C. A. Meyer）の他、アメリカ人参（*P. quinquefolium* L.）、三七人参（田七人参、*P. notoginseng*）も使用することができる。本発明の組成物の成分を得るには、オタネニンジンおよびその近縁種から選択される植物（以下、オタネニンジン等という。）や、チクセツニンジンおよびその近縁種から選択される植物（以下、チクセツニンジン等という。）を用いることが好ましい。本組成物においては、好ましくは、これらの植物の根を用いる。オタネニンジン及びチクセツニンジン及びこれらの近縁種植物の根を始めとして、これらのニンジンの根は、通常は、乾燥された状態で入手できる。あるいは、アルコール浸漬液などとしても、入手することができる。本組成物の原料としては、好ましくは乾燥物を用いる。

【0025】ウコギ科植物の根は、いわゆる植物体の根であってもよいが、あるいは培養細胞であってもよい。培養細胞の場合には、好ましくは根由来の培養細胞である。なお、植物体の根由来原料を含んでいれば、植物体の根以外の他の部位を含んだ原料も使用することができる。

【0026】（ウコギ科植物由来成分の取得方法）また、本組成物における有効成分は、ウコギ科植物原料を必要に応じて乾燥し、粉碎等して得られる粉末、あるいは、当該原料の抽出液の減圧濃縮などにより得られる濃縮物（エキス）や乾燥物から得られる粉末とすることができる。粉末形態の場合、粒径は、特に限定しないが、42メッシュ以下とすることが好ましい。42メッシュを超えると打錠性能に影響を及ぼすからである。

【0027】ウコギ科植物由来成分を、ウコギ科植物原料の粉碎（好ましくは乾燥）粉末として取得する場合、原料の乾燥方法や粉末化方法は特に限定しないで、各種公知の方法を採用することができる。乾燥方法としては、熱風乾燥などを好ましく採用することができる。

【0028】ウコギ科植物由来成分を、原料の水および／または有機溶媒（エタノール、メタノールなどのアルコールの他、アセトンなどを用いることができる）による抽出液から得られるエキス粉末とする場合、抽出にあたって原料を予め粉状、細片状としておくことが好ましい。より好ましくは、約7mm角以下の碎片状であり、さらに好ましくは、約4mm～約6mmであり、最も好ましくは約5mmの細片状である。0.5mm～2mm角の細片状が好ましい場合もある。培養細胞を原料とする場合には、乾燥した粉末状体を用いることが好ましい。

【0029】水で抽出する場合、使用する水は特に限定しないが、抽出にあたって加熱することが好ましい。好ましくは、約80～約100℃であり、より好ましくは、約90～約95℃である。また、抽出原料に対する水の量も特に限定するものではないが、原料約3～約25重量部、好ましくは、約5～約20重量部、より好ましくは約20重量部に対して、抽出後の水量が約200～約800重量部（好ましくは、約500～700重量部）になるように抽出用の水量を設定することが好ましい。この濃度範囲で最終抽出液が調製されると、そのままで経口投与に好ましい濃度であるとともに、有効な抽出が行われるからである。

【0030】加熱抽出操作が、水分の蒸発による減量を許容する状態で行われるときは、その間の水分の減量を想定して、当初の抽出用水の量を設定する。例えば、水量を所望の最終水量に対して50～60%程度増量して抽出する。一方、加熱抽出操作が、水分の蒸発による減量が許容されない状態で行われるときには、当初より、最終的に得ようとする抽出水量の水を原料に対して加えて加熱を行えばよい。好ましくは環流凝縮器を用いて行う。

【0031】加熱抽出操作は、大気開放型の容器や、還流凝縮器を用いることができる。特に、有効成分の抽出阻害や抽出成分の有効性を維持するために、ガラス製、ホーロー製、セラミックス製の他、金属部分を耐食性被膜で塗装あるいは加工した材料等を使用することが好ましい。抽出時間も特に限定はしないものの、少なくとも1時間であることが好ましく、より好ましくは、1.5時間以上であり、さらに好ましくは2.5時間以上である。上限は3～4時間とする。

【0032】植物体であるウコギ科植物の根を水で抽出する場合の典型例として以下の操作を挙げることができる。細片状に破碎したニンジンの乾燥根約3～20gに対して、熱水800ml～1000mlを加えて、前記した加熱範囲で抽出液残量が約200ml～約700mlになるように煎じる。好ましくは、抽出液温度を90～95℃に維持しつつ、1.5～3時間程度で約200ml～約700mlとなるような加熱調整を行う。特に、同量のニンジン原料に対して水約200ml～約7

00mlで環流凝縮器を用いて約2時間煮沸抽出を実施するのがよい。このような操作で得た抽出液は、そのまま経口投与に適した濃度の液体となる。

【0033】アルコールで抽出する場合、エタノールを使用することが好ましい。アルコールを用いて抽出する場合、アルコールのみで抽出してもよいが、好ましくは、水と混合して混液で抽出することが好ましい。好ましくは、アルコール濃度が50v/v%下であり、より好ましくは35v/v%程度とする。アルコール含有抽出液は、特に限定しないが、抽出にあたって加熱することが好ましい。好ましくは、50～80℃であり、より好ましくは、75℃以下であり、さらに好ましくは70℃以下である。抽出時間も特に限定はしないものの、10時間以上であることが好ましく、より好ましくは20時間以上であり、最も好ましくは30時間程度あるいはそれ以上である。なお、最終的な経口投与時にはアルコール濃度が20v/v%程度であることが好ましい。例えば、20v/v%を超える濃度のアルコール溶液で抽出した場合は、抽出後に水で希釈して20v/v%以下となるようにするすることが好ましい。好ましくは、10v/v%以下であり、より好ましくは、5v/v%以下である。また、抽出原料（ニンジンの根）に対する抽出液量も特に限定するものではないが、原料約30～200gに対して抽出液1000mlとすることが好ましい。抽出のための容器は、水のみで抽出する場合と同様のものを使用することが好ましい。抽出操作は、環流凝縮器を用いて行うのが好ましい。

【0034】ウコギ科植物の根を水／アルコール混液で抽出する場合の典型例として以下の操作を挙げができる。細片状に破碎したウコギ科植物の乾燥根約200gに35v/v%エタノール溶液を加えて1000mlとし、この液を約70℃に維持して約30時間煎じる。30時間経過後、全量が1000mlとなるように熱水（あるいは水）を加える。なお、最終的にアルコール濃度が約20v/v%となることが好ましい。

【0035】得られた抽出液は、必要に応じて、ろ過等される。さらに、減圧濃縮などにより濃縮物（エキス）とし、その後、必要に応じて乾燥し、さらに粉末とすることができます。乾燥方法としては、大量に乾燥する観点からスプレードライ方式を採用することが好ましい。また、品温の上昇が回避できるため、有効成分が分解されずに維持される点においては、凍結乾燥方式を採用することが好ましい。抽出液、濃縮物、乾燥物は、いずれも、本組成物におけるウコギ科植物由来成分として使用することができるが、抽出液及び濃縮物については、抽出液乾燥物あるいは既述の粉碎粉末と混合することにより、賦形剤組成物成分として使用しやすくなる。

【0036】なお、担子菌原料として2種類以上の担子菌を用いる場合、それぞれの種類について別個に抽出液を調製することもできるが、同時に一括して抽出するこ

ともできる。ウコギ科植物についても同様である。さらに、担子菌原料とウコギ科植物の根原料は、それぞれ単独に抽出することもできるが、双方を含む原料組成物を同じ抽出媒体で抽出して同時に抽出することもできる。好ましくは、同時抽出する。同時抽出する場合においても、上記した担子菌原料あるいはウコギ科植物の根原料におけるいずれかの抽出条件を採用することができる。

【0037】また、本組成物における担子菌由来成分とウコギ科植物由来成分とは、上記したそれぞれの各種様を適宜組み合わせることができる。すなわち、担子菌由来成分とウコギ科植物由来成分とは、それぞれ、粉碎粉末と抽出液経由の各種形態（抽出液、エキス、乾燥粉末）とがあり、それぞれ成分形態からの1種あるいは2種以上を選択して、本組成物を構成することができる。好ましくは、担子菌由来成分のウコギ科植物由来成分として、それぞれ破碎粉末を使用することが好ましい。また、これら各破碎粉末を主体とし、適宜、各成分の各種抽出液経由形態の1種あるいは2種以上を混合することも好ましい態様である。このような態様によれば、賦形剤組成物中における各成分の濃度を高めることができる。

【0038】また、本組成物における、担子菌原料とウコギ科植物の原料との比は適宜設定することができるが、各原料の乾燥重量に換算した場合の重量比として、約13.5～約16.5（好ましくは約15）：約2.7～約3.3（好ましくは約3）とすることができる。特に、担子菌原料を、マンネンタケとカワラタケとする場合には、マンネンタケ：カワラタケ：ウコギ科植物の比を約9～約11（好ましくは約10）・約4.5～約5.5（好ましくは約5）：約2.7～約3.3（好ましくは約3）とすることができる。さらに、担子菌原料とウコギ科植物原料との比を、約1.8～約2.2（好ましくは約2.0）：約9～約11（好ましくは約1.0）とすることができる。また、マンネンタケ：カワラタケ：ウコギ科植物の比を約4.5～約5.5（好ましくは約5）・約9～約11（好ましくは約1.0）：約2.7～約3.3（好ましくは約3）とすることができる。担子菌原料とウコギ科植物原料との比を、約1.8～約2.2（好ましくは約2.0）：約9～約11（好ましくは約1.0）とすることができる。特に、担子菌原料を、マンネンタケとカワラタケとする場合には、マンネンタケ：カワラタケ：ウコギ科植物の比を約9～約11（好ましくは約1.0）・約9～約11（好ましくは約1.0）：約9～約11（好ましくは約1.0）とすることができる。

【0039】このようにして得られる担子菌由来成分とウコギ科植物由来成分は、いずれも、多糖類を主成分としている。また、適度な圧縮性と水浸漬時の崩壊性もしくは溶出性を備えている。したがって、本組成物を、任意の有効成分の粉末、濃縮物（エキス）などに対して供給して賦形することにより、容易に経口摂取用組成物を

提供することができる。このため、本組成物は、錠剤、粒剤、散剤、コーティング錠剤などの各種経口摂取用製剤の他、栄養補助食品を含む飲食品などの経口摂取用組成物の賦形剤として好ましく用いることができる。

【0040】例えば、錠剤や粒剤に適用する場合、有効成分と、担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する賦形剤組成物とを含有するように構成することができる。また、有効成分を含むコアと、このコアを被覆する、担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有するシェル、とを備える、錠剤とすることができる。この場合、シェルは、コーティング層あるいは糖衣層を構成することができる。また、粒剤とする場合、有効成分を含むコアとこのコアを被覆する担子菌類サルノコシカケ科に属する1種あるいは2種以上の担子菌由来成分とウコギ科に属する植物由来成分とを含有する層とを有する粒子を含有するように構成することができる。

【0041】なお、本組成物を用いた経口摂取用組成物の態様は、上記の他、カプセル剤、チュアブル剤等の製剤（医薬品の他健康食品としての製剤を含む）、チュウイングガム、冰菓、あめ、クッキー、ビスケット、スナック菓子などの菓子類、茶などの飲料もしくは飲料調製用粉末などの嗜好品等を含む食品とすることができます。また、使用時に、水分を添加して、液状体を回復できるような用時溶解性の固体（粉末あるいは成形体）とすることも好ましい。かかる形態の選択及びその選択に応じた製剤化や飲食品などの製品化は当業者において周知の事項である。さらに、発酵促進添加剤としても使用することができ、当該添加剤として本組成物を含有する発酵食品も提供することができる。

【0042】また、本組成物が含有する担子菌由来成分とウコギ科植物由来成分とは、それぞれ、本来的に担子菌由来の有効成分とウコギ科植物由来成分との双方を有している。したがって、本組成物を賦形剤として使用することにより、これらの有効成分が有する各種生理活性作用を製品に付与することができる。本発明者らによれば、これらの生理活性は、抗腫瘍活性、抗高脂血症活性、血圧降下活性、血糖値降下活性などであることがわかっている。

【0043】本組成物が発現する抗腫瘍活性は、特に、白血病、リンパ腫、子宮頸ガン、肺ガン、卵巣ガン、乳腺ガン（転移）、皮膚ガン（転移）、乳腺ガン、皮膚ガンに対する活性を有している。白血病としては、赤芽球性白血病を例示できる。

【0044】本発明の組成物が発現する抗高脂血症活性は、ヒトを含む哺乳類の血中の総コレステロール低下作用を有している。また、ヒトにおいて、特に、HDLコレステロールに対して相対的に多くのLDLコレステロ

ールを低下させる作用を有している。また、HDLコレステロールを増加させる作用を有する。加えて、ヒトにおいて、血中トリグリセライド濃度によって代表される中性脂肪の低下作用を有している。

【0045】特に、ヒトにおける総コレステロール低下作用、LDLコレステロール低下作用、HDLコレステロール増加作用などは、血糖値が正常（典型的には、空腹時血糖値が120mg/dl以下）～境界領域（例えば、空腹時血糖値が120mg/dlを超える、140mg/dl未満）で、かつ総コレステロール量が正常～高脂血症の患者において有効に発揮される。これらの患者に対しては、血中トリグリセライド量の低下作用も発揮される。すなわち、本組成物は、糖尿病、特に、インシュリン非依存性糖尿病患者における合併症としての高脂血症に有効に作用して総コレステロールおよび/またはLDLコレステロールを低下させることができる。なお、本発明の組成物は、インシュリン様作用も併せ有している。すなわち、糖尿病患者に投与した場合において、血糖値及びC-ペプチドの血中濃度の低下が観察されている。したがって、本組成物を、糖尿病の予防用あるいは治療用の組成物としても用いることができる。

【0046】本発明の組成物は、インシュリン非依存性糖尿病患者に対する他の糖尿病治療用薬剤の投与に併用することができる。すなわち、本組成物は、他の糖尿病治療用剤と併用した場合においても、総コレステロール低下作用、LDLコレステロール低下作用を奏する。本組成物は、組成物自体の投与による副作用をほとんど発現しないし、また、免疫活性化作用等により、他の糖尿病治療剤による副作用を低減することができる。

【0047】本発明の組成物は、投与なし飲食開始後、手足のしびれの解消、体に力を感じる、身体の痛みの緩和、疲れにくい、顔色がよくなる、食欲増進、といった健康増進現象が観察される。

【0048】本発明の組成物は、上記したコレステロール等の低下作用及び血糖値等の低下作用を有する一方、同時に上記健康増進作用も同時に併せ有している。このことから、本組成物は、各種疾患治療用の有効成分原末などとともに使用することにより、同時に本組成物のこれらの副作用を軽減し、健康増進を図ることができる。すなわち、本組成物を使用した経口摂取用組成物は、有効成分による治療なし予防効果とともにQOLを改善、向上できる組成物となっている。

【0049】なお、上記した本組成物が有する生理活性あるいはこれに類似する生理活性を有する有効成分に対して、本組成物を賦形剤として用いることにより、当該有効成分と本組成物との相乗効果により、より高い生理活性が発現可能となっている。また、同時に、当該有効成分による副作用の軽減、健康増進作用を発現可能な経口摂取用組成物を提供することができる。また、本組成物を、担子菌由来の有効成分および/またはウコギ科植

物由来の有効成分に対する賦形剤として、本組成物を適用することにより、製品あたりの有効成分量を増大させることができ、これにより高い効能効果の発現が可能となる。

【0050】また、本組成物中の担子菌由来成分およびウコギ科植物由来成分は、理由は明らかではないが、抗酸化作用を有している。このことは、これらの由来成分の溶解液あるいは懸濁液を空気中に放置しておくと、その電位が徐々に低下していくことから明らかである。したがって、経口摂取用組成物中の有効成分の酸化分解を防止することができ、有効成分の安定性を向上させることができる。したがって、本組成物は、賦形剤であるとともに有効成分の抗酸化剤あるいは安定化剤としても機能することができ、本組成物を用いることにより、優れた有効成分安定性を保有する経口摂取用組成物を提供することができる。

【0051】なお、本組成物には、担子菌類由来成分とウコギ科植物由来成分の他、従来賦形剤として使用する従来賦形剤として使用されてきた乳糖やデンプン、ヒドロキシプロピルセルロースなどの材料を含めることもできる。また、他の原料の粉碎粉末や抽出液、抽出エキス、抽出エキス乾燥粉末を含めることもできる。例えば、しいたけ、きくらげなどを用いることができる。

【0052】

【実施例】以下、本発明について具体例を挙げて説明するが、本発明はこれらの実施例によって何ら限定的に解釈されるものではない。

（実施例1）図1に、有効成分を構成する抽出エキス粉末の製造工程を示す。レイシ（乾燥物）500g、カワラタケ（乾燥物）500g、チクセツニンジン（乾燥物）500g、しいたけ（乾燥物）150g、きくらげ（乾燥物）150g、大豆（乾燥物）20g、落生衣（乾燥物）20gとを、それぞれ粉碎して細片とした後、水40Lを加えて、100℃で1時間還流しながら抽出した。この抽出液を200メッシュでろ過し、その後、65℃で、650mmHgで減圧濃縮した。

【0053】得られた濃縮物を95℃で30分間加熱して、殺菌した上で、スプレードライ法により乾燥した、条件は、入口温度200℃、出口温度100℃とした。また、乾燥前の濃縮物は固体分濃度が約20%であった。

【0054】得られた乾燥粉末を42メッシュで篩過し、抽出エキス粉末とした。なお、回収率は、原料重量の約20%であった。なお、この抽出エキス粉末は、同時に、本発明の賦形剤組成物（抽出液経由）である。

【0055】（実施例2）レイシ（乾燥物）500g、カワラタケ（乾燥物）250g、チクセツニンジン（乾燥物）150gとを、それぞれ粉碎して細片とした後、さらに、微粉末化し、42メッシュで篩過して、賦形剤組成物（微粉末）とした。

【0056】(実施例3)

(打錠試験1) 図2には、打錠試験1及び2の工程、組成及び打錠結果を示す。本試験は、実施例1の抽出工キス粉末のみを用いて打錠用ブレンドとし、打錠を行った。打錠に際しては、打錠用ブレンドを、1錠当たり7.5mgとなるように所定サイズの打錠機に導入し、厚み3.2mm、粒径6.5mmの錠剤を得た。

【0057】(打錠試験2) 本試験は、実施例2の賦形剤組成物(微粉末)のみを用いて打錠用ブレンドとし、打錠を行った。打錠に際しては、打錠用ブレンドを、1錠当たり7.4mgとなるように所定サイズの打錠機に導入し、厚み3.3mm、粒径6.5mmの錠剤を得た。

【0058】打錠試験1で得られた錠剤は、硬度1.9、水分(カールフィッシャー法)5.40%であった。また、打錠試験2で得られた錠剤は、硬度1.5、

水分(カールフィッシャー法)4.60%であった。また、いずれの打錠作業においても、かけや割れなどは殆どなく、また、錠剤の水中における崩壊性も良好であった。

【0059】打錠試験によれば、賦形剤組成物は、いずれも、良好な打錠性能を有することがわかった。また、ラクトースとの混合性を確認したところ、当該混剛性も良好で、ラクトースとともに賦形剤組成物を構成できることもわかった。

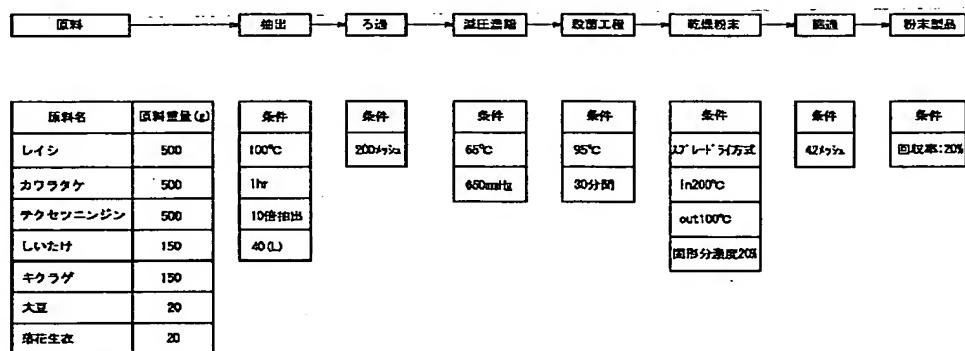
【図面の簡単な説明】

【図1】実施例1の賦形剤組成物の調製工程の概略を示す図である。

【図2】実施例1及び2において得られた賦形剤組成物の打錠工程の概略を示す図である。

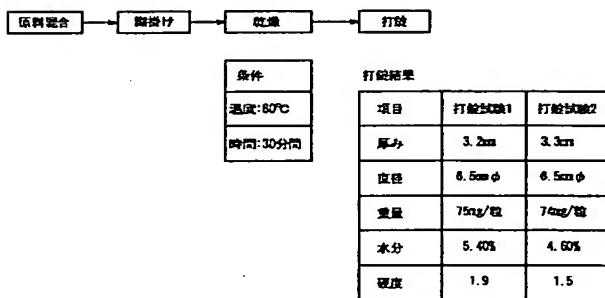
10

【図1】



【図2】

打錠工程



フロントページの続き

(51) Int.C1.7

識別記号

F I

マーク(参考)

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/12

35/00

35/00

35/02

35/02

// A 6 1 K 35/78

A 6 1 K 35/78

A
M

F ターム(参考) 4C076 AA29 AA37 BB01 CC11 CC21
CC27 CC40 EE58A FF64
FF67 GG01
4C088 AA04 AB16 AC11 AC17 BA07
BA09 BA10 MA07 MA35 MA41
MA52 NA05 NA06 ZA36 ZB26
ZB27 ZC33 ZC35